

Refined compound thrombolytic anti-dementia drug of docosahexaenoic acid ethyl

Publication number: CN1082909

Publication date: 1994-03-02

Inventor: YUZHEN PAN (CN); RONGKUI LIU (CN); ZHE LIU (CN)

Applicant: PAN YUZHEN (CN)

Classification:

- **international:** (IPC1-7): A61K35/78

- **European:**

Application number: CN19931000040 19930103

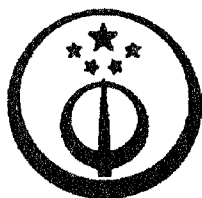
Priority number(s): CN19931000040 19930103

[Report a data error here](#)

Abstract of **CN1082909**

Antithrombosis, antidementia drug containing multiple component, of which docosahexaenoic acid ethyl is essential and obtained by refining black scraper oil features high curative effect and multiple functions. It can cure senile dementia, paraplegia, prostatitis, diabetes mellitus, cardiovascular disease, cerebrovascular disease and their complications.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide



[12] 发明专利申请公开说明书

[21]申请号 93100040.8

[51]Int.Cl⁵

A61K 35/78

[43]公开日 1994年3月2日

[22]申请日 93.1.3

[71]申请人 潘玉珍

地址 100011北京市安定门外西河沿五号楼4
门 503 号

共同申请人 刘荣遼 刘 哲 刘 华 刘
晶

[72]发明人 潘玉珍 刘荣遼 刘 哲
刘 华 刘 晶

说明书页数:

附图页数:

[54]发明名称 精制二十二碳六烯酸乙酯复合溶栓、抗
痴呆药剂

[57]摘要

本发明是以马面鲈鱼油精制的二十二碳六烯酸乙酯为主体的多组分复合制作的抗栓、抗痴呆症药物。其特征是利用多组分之间的相辅相成作用,相互增效作用和多组分的多功能作用,提高复合药物的疗效和功能。使其不仅能治疗老年痴呆症、截瘫症、前列腺炎、糖尿病和心脑血管疾病,而且能治疗这些综合性的并发症。

权 利 要 求 书

1. 一种精制DHA乙酯复合溶栓、抗痴呆药剂，其特征在于，该药剂含有DHA—E、EPA—E，在马面鲩鱼油中含有的其他PUFA—E、大豆卵磷脂、月见草油和银杏叶素。

2. 根据权利要求1所述的复合药剂的配制比例是(DHA—E)：(EPA—E)：(其他PUFA—E)：大豆卵磷脂：月见草油：银杏叶素 = (50：10：24：8：7：1) ~ (55：15：13：13：2：2)

3. 根据权利要求1和权利要求2所述的其他PUFA—E是指精制马面鲩鱼油过程中与精制的DHA—E和EPA—E一起保留下来的二十碳三烯酸、四烯酸、二十二碳三烯酸、四烯酸、五烯酸的乙酯。

4. 权利要求1的复合溶栓、抗痴呆药剂的用途，其特征在于，该药剂及以它为主制成的药剂可用于治疗老年痴呆症、截瘫症、前列腺炎、脑梗塞、心肌梗塞、高低血压、糖尿病和红斑狼疮等症及它们的综合症。

精制二十二碳六烯酸乙酯复合溶栓、抗痴呆药剂

本发明涉及以马面鲈鱼油精制的二十二碳六烯酸乙酯(ethyl Docose Hexaenoic Acid缩写为DHA—E)为主体的多组份复合药物,主要用于溶解血栓、治疗老年痴呆症、心脑血管疾病及其综合症。

血栓可以导致老年痴呆症和心脑血管疾病,而老年痴呆症至年被认为是不可治之症,心脑血管疾病在世界上许多国家成为第一杀手,特效药品尚感缺乏。DHA等高不饱和脂肪酸有抑制血小板聚集、降低血脂、溶解纤维蛋白原等功能,经过合理地配方,将可得到较理想的防治心脑血管疾病的药物,特别是DHA是构成大脑灰质素的主要成份,是大脑生长发育的必须脂肪酸,它有增强记忆力等功能,经过合理处方,将会创造出防治老年痴呆症的有效药物。

现有的DHA或EPA类药物都是DHA或EPA二十碳五烯酸(Eicosa Petaenoi Acid的缩写)及其酯类的单组份药,其中DHA或EPA单组份的含量都在95%以上时才承认为药或进入药典。而DHA和EPA的多组份的产品都不是药,它们的DHA+EPA的含量都只有30%左右, DHA的含量在12%左右,由于它们的有效组份含量低,疗效不显著,都只被当作营养食品来制作和使用。这些营养食品中的DHA和EPA都不是用马面鲈鱼制作,是其它种鱼油的精制品,主要组份未经精制或浓缩,腥味浓、杂质多有副作用。

本发明是以马面鲈鱼油精制的DHA—E(DHA的乙酯)为主体,按下面的比例处方,制成的药剂:

(DHA—E) : (EPA—E) : (其它PUFA—E) : 大豆卵磷脂 : 月见草油 : 银杏叶素 = (50 : 10 : 24 : 8 : 7 : 1) ~ (55 : 15 : 13 : 13 : 2 : 2) 其中, PUFA—E(Polyunsaturated fatty acid ethyl) 是代表马面鲈鱼油

中DHA—E和EPA—E以外的其它不饱和脂肪酸乙酯、银杏叶素是银杏叶精制提取物，它主要含有白果内脂A、B、C、M和银杏苦内酯等。本处方中DHA—E含量应在50%以上， $(\text{DHA—E}) + (\text{EPA—E}) > 65\%$ ，这是因为无论单组份还是多组份复合处方，其中的主要组份DHA—E的含量都不能太低，否则从疗效上看它将降低为营养食品。但也用不着太高，临床试验结果表明：在多组份复合处方的条件下，DHA—E含量为50%或是70%同时医治相关疾病，疗效无明显差异，但将DHA—E含量降至40%以下，并且不采用上述复合处方的增效措施时，疗效将降低8~10倍。

本发明所以采用多组份复合药剂处方，而不采用单组份处方是因为血栓引起心脑血管疾病常常引起多种综合性的并发症，这并发症只靠一种单组份的单纯的、局限性的治疗功能是满足不了要求的，例如DHA—E是大脑生长发育的必须脂肪酸，它可以直接进入大脑，并通过抑制血小板小聚集功能起到一定的溶解脑部血栓作用，因此它在治疗脑神经系统疾病具有特殊的优势，而EPA—E在降低甘油三酯方面比DHA—E强，如果把它们合理组合起来，就会使各自的优势互相起到相辅相成的作用，而且有些组份之间，不仅是互相简单地补充功能，还能互相起到增效作用，像使用大豆卵磷脂和月见草油就是用来促进人体吸收DHA—E和EPA—E的，从而达到增效作用，而大豆磷脂在本处方中还起到良好的抗氧化剂作用。银杏素中的白果内脂是强有力的自由基清除剂，也是强抗氧化剂，当人们服用了容易过氧化的不饱和脂肪酸时，白果内脂在抗氧化方面对人体起重要保护作用。银杏叶素中的银杏苦内脂，是代谢增强剂可以促进脑细胞中DHA等组份的代谢，这有利于脑细胞功能的恢复，在使用DHA治疗老年痴呆症方面，这是本发明的一项锦上添花。总之以DHA—E为主的多组份复合剂，通过它们的相辅相成作用，通过相互增效作用和多组份的多功能作用，使其比单

组份药剂疗效增加，适应症增加，所以本发明DHA—E多组份复合药剂适合于治疗多种综合性并发症，并且在这方面比单组制剂优越，如有的患者患全瘫、痴呆、高血压、糖尿病等多种并发症，服用本发明药剂这多种并发症都基本痊愈。

本处方中使用的鱼油为马面鲷鱼油，只有马面鲷鱼油才能容易实现上述处方的比例，另外使用马面鲷鱼油通过精制手段制得的其它PUFA—E部份组份，如二十二碳三烯酸，四烯酸、五烯酸，由于它们也是高不饱和脂肪酸，它们也有类似疗效，并对DHA—E和EPA—E的功能起补充和辅助作用。如果去掉上述其它PUFA—E部份，而用纯DHA—E和EPA—E单组份按上述处方比例配制药剂，其疗效反到不如保留其它PUFA部份的疗效好。

本发明使用DHA等的乙脂是因为乙脂不会像甲酯那样在水解或与乙醇混合时有析出甲醇的危险，乙酯结构稳定。

本发明使用精制的DHA—E和EPA—E，这样可以除去鱼腥味和杂质，并不产生副作用。

本发明药剂在临床试验中表明：在治疗老年痴呆症、截瘫症、前列腺炎、脑梗塞、心肌梗塞、高低血压、糖尿病、红斑狼疮及以上并发症等疾病已经显示了明显疗效。

实施例：按

(DHA—E) : (EPA—E) : (其它PUFA—E) : 大豆卵磷脂 : 月见草油 : 银杏叶素=50 : 10 : 24 : 10 : 5 : 1，比例配制制剂药，其中DHA—E、EPA—E等不饱和脂肪酸均系从马面鲷鱼油中精制成。此处方制成的软胶囊丸，分别给数千名患有老年痴呆症、截瘫、前列腺炎、脑梗塞、心肌梗塞、高低血压、糖尿病、红斑狼疮及以上并发症等病患者服用90%以上的患者都有明显疗效。